

Customer No:

PATENT



22852

PATENT TRADEMARK OFFICE

Attorney Docket No. 05725.1033-00

IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

In re Application of:

Michel PHILIPPE et al.

Application No.: New U.S. Patent Application

Group Art Unit: Unassigned

Filed: March 4, 2002

Examiner: Unassigned

For: ANTI-WRINKLE COSMETIC OR  
PHARMACEUTICAL  
COMPOSITIONS COMPRISING  
POLYMERS AND SALTS THEREOF

Jc971 U.S. PTO  
10/086451



03/04/02

CLAIM FOR PRIORITY

Commissioner of Patents and Trademarks  
Washington, D.C. 20231

Sir:

Under the provisions of Section 119 of 35 U.S.C., Applicants hereby claim the benefit of the filing date of French Patent Application No. 01 02979, filed March 5, 2001, for the above identified United States Patent Application.

In support of Applicants' claim for priority, filed herewith is one certified copy of French Patent Application No. 01 02979.

If any fees are due in connection with the filing of this paper, the Commissioner is authorized to charge our Deposit Account No. 06-0916.

Respectfully submitted,

FINNEGAN, HENDERSON, FARABOW,  
GARRETT & DUNNER, L.L.P.

By:

Thomas L. Irving  
Reg. No. 28,619

Dated: March 4, 2002

FINNEGAN  
HENDERSON  
FARABOW  
GARRETT &  
DUNNER LLP

1300 I Street, NW  
Washington, DC 20005  
202.408.4000  
Fax 202.408.4400  
www.finnegan.com

THIS PAGE BLANK (11/17/70)



Jc971 U.S. PTO

10/086451



03/04/02

# BREVET D'INVENTION

## CERTIFICAT D'UTILITÉ - CERTIFICAT D'ADDITION

### COPIE OFFICIELLE

Le Directeur général de l'Institut national de la propriété industrielle certifie que le document ci-annexé est la copie certifiée conforme d'une demande de titre de propriété industrielle déposée à l'Institut.

Fait à Paris, le 24 JAN. 2002

Pour le Directeur général de l'Institut  
national de la propriété industrielle  
Le Chef du Département des brevets

Martine PLANCHE

INSTITUT  
NATIONAL DE  
LA PROPRIÉTÉ  
INDUSTRIELLE

SIEGE  
26 bis, rue de Saint Petersburg  
75800 PARIS cedex 08  
Téléphone : 33 (1) 53 04 53 04  
Télécopie : 33 (1) 42 93 59 30  
www.inpi.fr

THIS PAGE BLANK (USPTO)



26 bis, rue de Saint Pétersbourg  
75800 Paris Cedex 08  
Téléphone : 01 53 04 53 04 Télécopie : 01 42 94 86 54

# BREVET D'INVENTION CERTIFICAT D'UTILITÉ

Code de la propriété intellectuelle - Livre VI



N° 11354\*01

REQUÊTE EN DÉLIVRANCE 1/2

Cet imprimé est à remplir lisiblement à l'encre noire

D8 540 W / 260899

<b>5 MARS 2001</b> REMISE DES PIÈCES DATE <b>75 INPI PARIS</b> LIEU N° D'ENREGISTREMENT <b>0102979</b> NATIONAL ATTRIBUÉ PAR L'INPI DATE DE DÉPÔT ATTRIBUÉE PAR L'INPI <b>05 MARS 2001</b>		<b>1 NOM ET ADRESSE DU DEMANDEUR OU DU MANDATAIRE À QUI LA CORRESPONDANCE DOIT ÊTRE ADRESSÉE</b> L'OREAL - DPI Françoise LE BLAINVAUX 6 rue Sincholle 92585 CLICHY CEDEX	
<b>Vos références pour ce dossier</b> (facultatif) OA01091/CD			
<b>C nfirmation d'un dépôt par télécopie</b> <input type="checkbox"/> N° attribué par l'INPI à la télécopie			
<b>2 NATURE DE LA DEMANDE</b>		<b>Cochez l'une des 4 cases suivantes</b>	
Demande de brevet		<input checked="" type="checkbox"/>	
Demande de certificat d'utilité		<input type="checkbox"/>	
Demande divisionnaire		<input type="checkbox"/>	
<i>Demande de brevet initiale</i> N° _____ Date ____/____/____ <i>ou demande de certificat d'utilité initiale</i> N° _____ Date ____/____/____			
Transformation d'une demande de brevet européen <i>Demande de brevet initiale</i>		<input type="checkbox"/> N° _____ Date ____/____/____	
<b>3 TITRE DE L'INVENTION</b> Composition antirides comprenant un dérivé de polyaminoacides, et utilisation de ce composé pour lutter contre les rides de la peau			
<b>4 DÉCLARATION DE PRIORITÉ OU REQUÊTE DU BÉNÉFICE DE LA DATE DE DÉPÔT D'UNE DEMANDE ANTÉRIEURE FRANÇAISE</b>		Pays ou organisation _____ N° _____ Date ____/____/____ Pays ou organisation _____ N° _____ Date ____/____/____ Pays ou organisation _____ N° _____ Date ____/____/____ <input type="checkbox"/> S'il y a d'autres priorités, cochez la case et utilisez l'imprimé «Suit »	
<b>5 DEMANDEUR</b>		<input type="checkbox"/> S'il y a d'autres demandeurs, cochez la case et utilisez l'imprimé «Suite»	
Nom ou dénomination sociale		L'OREAL	
Prénoms			
Forme juridique		SA	
N° SIREN			
Code APE-NAF			
Adresse	Rue	14 rue Royale	
	Code postal et ville	75008	PARIS
Pays		FRANCE	
Nationalité		Française	
N° de téléphone (facultatif)		01 47 56 71 42	
N° de télécopie (facultatif)		01 47 56 73 88	
Adresse électronique (facultatif)			



# BREVET D'INVENTION CERTIFICAT D'UTILITÉ

REQUÊTE EN DÉLIVRANCE 2/2

<b>5 MARS 2001</b> REMISE DES PIÈCES DATE <b>75 INPI PARIS</b> LIEU N° D'ENREGISTREMENT NATIONAL ATTRIBUÉ PAR L'INPI		0102979 DB 540 W / 260899	
<b>Vos références pour ce dossier :</b> <i>(facultatif)</i>		OA01091/CD	
<b>6 MANDATAIRE</b>			
Nom		LE BLAINVAUX	
Prénom		Françoise	
Cabinet ou Société		L'OREAL	
N° de pouvoir permanent et/ou de lien contractuel			
Adresse	Rue	6 rue Sincholle	
	Code postal et ville	92585	CLICHY CEDEX
N° de téléphone <i>(facultatif)</i>		01.47.56.71.42	
N° de télécopie <i>(facultatif)</i>		01.47.56.73.88	
Adresse électronique <i>(facultatif)</i>			
<b>7 INVENTEUR (S)</b>			
Les inventeurs sont les demandeurs		<input type="checkbox"/> Oui <input checked="" type="checkbox"/> Non <b>Dans ce cas fournir une désignation d'inventeur(s) séparée</b>	
<b>8 RAPPORT DE RECHERCHE</b>		Uniquement pour une demande de brevet (y compris division et transformati n)	
Établissement immédiat ou établissement différé		<input checked="" type="checkbox"/> <input type="checkbox"/>	
Paiement échelonné de la redevance		<b>Paiement en trois versements, uniquement pour les personnes physiques</b> <input type="checkbox"/> Oui <input checked="" type="checkbox"/> Non	
<b>RÉDUCTION DU TAUX DES REDEVANCES</b>		<b>Uniquement pour les personnes physiques</b> <input type="checkbox"/> Requête pour la première fois pour cette invention <i>(joindre un avis de non-imposition)</i> <input type="checkbox"/> Requête antérieurement à ce dépôt <i>(joindre une copie de la décision d'admission pour cette invention ou indiquer sa référence) :</i>	
Si vous avez utilisé l'imprimé «Suite», indiquez le nombre de pages jointes			
<b>10 SIGNATURE DU DEMANDEUR OU DU MANDATAIRE</b> (Nom et qualité du signataire)  5/03/01      Françoise LE BLAINVAUX		<b>VISA DE LA PRÉFECTURE OU DE L'INPI</b>  <b>C. CONTE</b>	

La loi n°78-17 du 6 janvier 1978 relative à l'informatique, aux fichiers et aux libertés s'applique aux réponses faites à ce formulaire. Elle garantit un droit d'accès et de rectification pour les données vous concernant auprès de l'INPI.

La présente invention a pour objet l'utilisation de dérivés de polyaminoacides dans une composition notamment cosmétique ou dermatologique, destinée à être appliquée sur la peau ou les muqueuses, en particulier sur le visage, notamment pour le traitement, c'est-à-dire la diminution, l'effacement et/ou le lissage des rides et/ou ridules de la peau des êtres humains.

Au cours du processus de vieillissement, il apparaît différents signes caractéristiques sur la peau, se traduisant notamment par une modification de la structure et des fonctions cutanées. Les principaux signes cliniques du vieillissement cutané sont notamment l'apparition de ridules et/ou de rides, en augmentation avec l'âge. On constate en particulier une désorganisation du "grain" de la peau, c'est-à-dire que le micro-relief est moins régulier et présente un caractère anisotrope.

Il est connu de traiter ces signes du vieillissement en utilisant des compositions cosmétiques ou dermatologiques contenant des actifs capables de lutter contre le vieillissement, tels que les  $\alpha$ -hydroxyacides, les  $\beta$ -hydroxyacides et les rétinoïdes. Ces actifs agissent sur les rides en éliminant les cellules mortes de la peau et en accélérant le processus de renouvellement cellulaire. Toutefois, ces actifs présentent l'inconvénient de n'être efficaces pour le traitement des rides qu'après un certain temps d'application. Or, on cherche de plus en plus à obtenir un effet immédiat, conduisant rapidement à un lissage des rides et/ou ridules et à la disparition, même temporaire, des marques de fatigue.

Il a alors notamment été proposé d'utiliser une dispersion aqueuse de particules de polymère comme agent tenseur de la peau, conduisant à un camouflage des rides par lissage de la peau. Toutefois, ces compositions se présentent toujours sous forme aqueuse, ce qui peut entraîner, d'une part, des problèmes bactériologiques, et surtout, d'autre part, un démaquillage trop aisé en présence d'eau. En effet, il n'est pas possible, avec cette solution, de préparer une composition présentant une bonne rémanence à l'eau.

La demanderesse a constaté que, de façon surprenante et inattendue, l'utilisation de polymères bien particuliers, pouvait permettre l'obtention d'une composition susceptible d'être appliquée sur la peau et qui pouvait permettre d'améliorer le 'camouflage' et/ou d'estomper les rides et/ou ridules déjà formées, cet effet étant obtenu de façon immédiate.

En effet, les polymères mis en œuvre dans la présente invention constituent des agents tenseurs particulièrement efficaces. On entend par « agent tenseur » des composés susceptibles d'avoir un effet tenseur, c'est-à-dire pouvant tendre la peau et, par cet effet de tension, lisser la peau et y faire diminuer voire disparaître de façon immédiate les rides et les ridules.

L'invention a donc pour objet une composition antirides comprenant, dans un mi-

lieu physiologiquement acceptable, au moins un composé de formule (I) tel que ci-après défini.

Un autre objet de l'invention est l'utilisation d'au moins un composé de formule (I) ou d'une composition cosmétique le comprenant, pour diminuer, effacer et/ou lis-

ser les rides et/ou les ridules de la peau.

Un autre objet de l'invention est l'utilisation d'au moins un composé de formule (I) pour la fabrication d'une composition pharmaceutique destinée à diminuer, effacer et/ou lisser les rides et/ou les ridules de la peau.

Un autre objet de l'invention est l'utilisation d'au moins un composé de formule (I) ou d'une composition le comprenant, comme agent tenseur pour diminuer, lisser et/ou effacer les rides et/ou les ridules de la peau.

Un autre objet de l'invention est un procédé de traitement cosmétique d'une peau ridée consistant à appliquer sur la ride et/ou la ridule, une composition comprenant au moins un composé de formule (I).

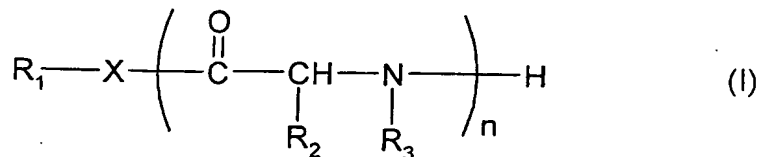
On a constaté que les composés selon l'invention présentent un très bon pouvoir tenseur de la peau. Les compositions selon l'invention sont facilement applicables et s'étalent aisément. Elles permettent d'estomper immédiatement après application les rides et les ridules à la surface de la peau.

Les compositions de l'invention peuvent notamment être appliquées sur le visage et/ou sur le cou, notamment sur le décolleté.

Par ailleurs, la synthèse de ces composés est très rapide, et aisément industrialisable. Ces composés sont préparés à partir d'acides aminés bien définis, conduisant à des oligomères et polymères à haute reproductibilité. Ceci est un grand avantage par rapport aux produits naturels pour lesquels la définition et la reproductibilité des lots sont très délicates à maîtriser.

Les compositions selon l'invention présentent une texture légère et sont très confortables à porter tout au long de la journée. Elles permettent l'obtention d'un film de très bonne tenue, mou, souple, élastique et flexible sur la peau; il suit les mouvements du support sur lequel il est déposé, sans se craqueler et/ou se décoller. Il adhère notamment parfaitement sur la peau du visage.

Les composés employés dans la présente invention sont donc des homopolymères répondant à la formule (I) :



dans laquelle :

- X est choisi parmi -O-, -S- ou -NR, avec R représentant un atome d'hydrogène ou un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

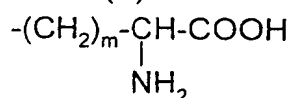


- R<sub>1</sub> est choisi parmi :

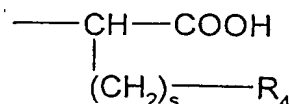
(i) un atome d'hydrogène,

(ii) un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>40</sub>, éventuellement substitué par au moins un hydroxy ou un radical -NR'R'', dans lequel R' et R'' représentent, indépendamment l'un de l'autre, un atome d'hydrogène ou un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; et/ou éventuellement interrompu par au moins un hétéroatome choisi parmi N, O ou Si,

(iii) un radical choisi parmi



et

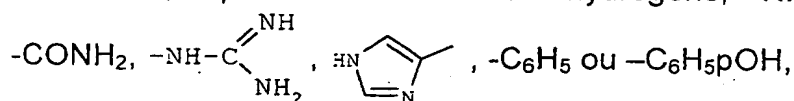


dans lesquels :

- m est 1, 2, 3, 4 ou 5;

- s est un entier compris entre 0 et 4 inclus;

- R<sub>4</sub> représente un atome d'hydrogène, -NH<sub>2</sub>, -OH, -SH, -CHOHCH<sub>3</sub>,



- R<sub>2</sub> représente un atome d'hydrogène, un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, ou un radical choisi parmi -CH<sub>2</sub>OH, -CHOH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>p-OH et -(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-NH<sub>2</sub>, avec t étant 1, 2, 3, 4 ou 5;

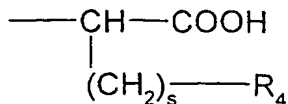
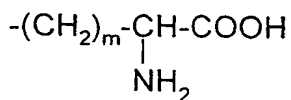
- R<sub>3</sub> représente un atome d'hydrogène ou un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

- n est un nombre moyen d'unités répétitives supérieur à 1, et tel que le poids moléculaire du dérivé de polyaminoacide est compris entre 200 et 200.000, l'unité répétitive étant soit identique pour un même composé, soit différente, R<sub>2</sub> et/ou R<sub>3</sub> prenant alors au moins l'une des autres significations données pour ces radicaux.

Les composés de formule (I) peuvent également se présenter sous forme de sels minéraux ou organiques, compatibles avec une application dans les domaines cosmétique ou pharmaceutique.

De préférence, X représente O, S ou N-CH<sub>3</sub>.

De préférence, R<sub>1</sub> représente un atome d'hydrogène; un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>22</sub>, notamment en C<sub>4</sub>-C<sub>20</sub>, ou un radical choisi parmi :



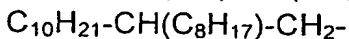
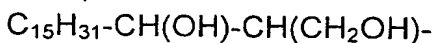
dans lesquels m, s et R<sub>4</sub> ont les significations données ci-dessus.

- 5 De préférence, R<sub>2</sub> représente un atome d'hydrogène, un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, ou un radical -CH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>p-OH.

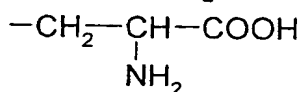
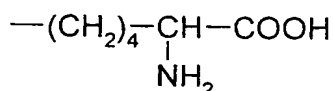
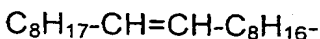
De préférence, R<sub>3</sub> représente un atome d'hydrogène ou un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, notamment méthyle ou éthyle.

10

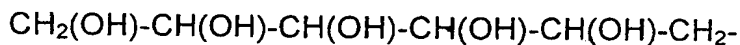
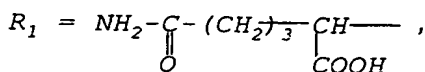
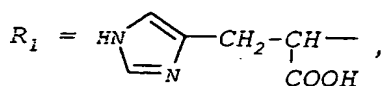
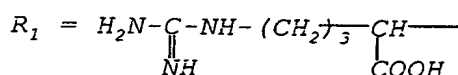
En particulier, on peut citer les composés de formule (I) dans lesquels le radical R<sub>1</sub> représente l'une des formules suivantes :



15 C<sub>16</sub>H<sub>33</sub>-



20

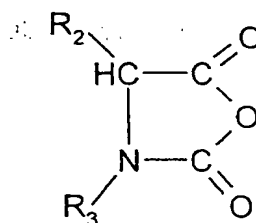


25

De préférence, n est compris entre 3 et 500 et/ou est tel que le poids moléculaire du dérivé de polyaminoacide est compris entre 300 et 50 000.

30

Les dérivés de polyaminoacides de formule (I) peuvent être obtenus par des procédés bien connus de l'homme du métier, et notamment grâce à une réaction de polycondensation entre au moins un N-carboxyanhydride de formule :



et un composé nucléophile de formule  $R_1\text{-XH}$  dans laquelle  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_3$  et  $X$  ont les mêmes significations que celles données ci-dessus pour la formule (I).

5 Ce procédé est notamment décrit dans la demande française FR2776510.

Les dérivés de polyaminoacide peuvent être utilisés, seuls ou en mélange, en une quantité de 0,001 à 30% en poids par rapport au poids total de la composition, de préférence en une quantité de 0,01 à 15% en poids par rapport au poids total de  
10 la composition.

Les composés selon l'invention peuvent recevoir des applications diverses, notamment dans des compositions cosmétiques ou pharmaceutiques, qui comprennent alors un milieu physiologiquement acceptable, notamment cosmétiquement  
15 ou pharmaceutiquement acceptable.

Ce milieu, ses constituants, leur quantité, la forme galénique de la composition et son mode de préparation, peuvent être choisis par l'homme du métier sur la base de ses connaissances générales en fonction du type de composition recherchée.  
20

D'une manière générale, ce milieu peut être anhydre ou aqueux.

Lorsque la composition comprend une phase aqueuse, ladite phase peut comprendre de l'eau, une eau florale et/ou une eau minérale.

25 Ladite phase peut comprendre en outre des alcools tels que des monoalcools en  $C_1\text{-}C_6$  et/ou des polyols tels que le glycérol, le butylèneglycol, l'isoprène glycol, le propylèneglycol, le polyéthylèneglycol.

La composition peut également comprendre une phase grasse, notamment constituée de corps gras liquides à  $25^\circ\text{C}$ , tels que des huiles d'origine animale, végétale, minérale ou synthétique, volatiles ou non; de corps gras solides à  $25^\circ\text{C}$  tels que des cires d'origine animale, végétale, minérale ou synthétique; de corps gras pâteux; de gommes; de leurs mélanges.  
30

Les huiles volatiles sont généralement des huiles ayant, à  $25^\circ\text{C}$ , une tension de vapeur saturante au moins égale à 0,5 millibar (soit 50 Pa).  
35

Parmi les constituants de la phase grasse, on peut citer :

- les silicones volatiles cycliques ayant de 3 à 8 atomes de silicium, de préférence de 4 à 6;

- les cyclocopolymères du type diméthylsiloxane/méthylalkylsiloxane,
- les silicones volatiles linéaires ayant de 2 à 9 atomes de silicium;
- les huiles volatiles hydrocarbonées, telles que les isoparaffines et notamment l'isododécane et des huiles fluorées;
- 5 - les polyalkyl(C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>) siloxanes et notamment ceux à groupements terminaux triméthylsilyle, parmi lesquels on peut citer les polydiméthylsiloxanes linéaires et les alkylméthylpolysiloxanes tels que la cétaldiméthicone (nom CTFA),
- les silicones modifiées par des groupements aliphatiques et/ou aromatiques, éventuellement fluorés, ou par des groupements fonctionnels tels que des grou-
- 10 pements hydroxyles, thiols et/ou amines.
- les huiles de silicone phénylées,
- les huiles d'origine animale, végétale ou minérale, et notamment les huiles ani-
- 15 males ou végétales formées par des esters d'acide gras et de polyols, en particu-
- lier les triglycérides liquides, par exemple les huiles de tournesol, de maïs, de so-
- ja, de courge, de pépins de raisin, de sésame, de noisette, d'abricot, d'amandes
- ou d'avocat; les huiles de poisson, le tricaprocaprylate de glycérol, ou les huiles
- végétales ou animales de formule R<sub>1</sub>COOR<sub>2</sub> dans laquelle R<sub>1</sub> représente le reste
- 20 d'un acide gras supérieur comportant de 7 à 19 atomes de carbone et R<sub>2</sub> repré-
- sente une chaîne hydrocarbonée ramifiée contenant de 3 à 20 atomes de car-
- bone, par exemple, l'huile de Purcellin; l'huile de paraffine, de vaseline, le perhy-
- 25 drosqualène, l'huile de germes de blé, de calophyllum, de sésame, de macada-
- mia, de pépins de raisin, de colza, de coprah, d'arachide, de palme, de ricin, de
- jojoba, d'olive ou de germes de céréales; des esters d'acides gras; des alcools;
- des acétylglycérides; des octanoates, décanoates ou ricinoléates d'alcools ou de
- 30 polyalcools; des triglycérides d'acides gras; des glycérides;
- les huiles fluorées et perfluorées.
- les gommes de silicones;
- les cires d'origine animale, végétale, minérale ou synthétique telles que les cires
- microcristallines, la paraffine, le pétrolatum, la vaseline, l'ozokérite, la cire de
- 35 montan; la cire d'abeilles, la lanoline et ses dérivés; les cires de Candellila, d'Ou-
- ricury, de Carnauba, du Japon, le beurre de cacao, les cires de fibres de lièges ou
- de canne à sucre; les huiles hydrogénées concrètes à 25°C, les ozokérites, les
- esters gras et les glycérides concrets à 25°C; les cires de polyéthylène et les cires
- obtenues par synthèse de Fischer-Tropsch; des huiles hydrogénées concrètes à
- 40 25°C; des lanolines; des esters gras concrets à 25°C; les cires de silicone; les
- cires fluorées.

La composition peut comprendre en outre tout additif usuellement utilisé dans le

40 domaine d'application envisagé, tel que des tensioactifs, des antioxydants, des

parfums, des huiles essentielles, des conservateurs, des actifs cosmétiques ou

pharmaceutiques, des vitamines, des acides gras essentiels, des sphingolipides,

des agents autobronzants, des filtres solaires, des polymères filmogènes, des

épaississants, des gélifiants, des colorants, des pigments, des charges, des na-

crés. Bien entendu l'homme du métier veillera à choisir les éventuels composés complémentaires et leur quantité, de manière telle que les propriétés avantageuses de la composition selon l'invention ne soient pas, ou substantiellement pas, altérées par l'adjonction envisagée.

5

La composition de l'invention peut se présenter sous toutes les formes galéniques normalement utilisées pour une application topique, notamment sous forme d'une solution aqueuse, hydroalcoolique ou huileuse; d'une émulsion huile-dans-eau, eau-dans-huile ou multiple, de consistance liquide ou semi-liquide du type lait, ou  
10 de consistance molle, semi-solide ou solide du type crème; d'un gel aqueux ou huileux; d'un produit anhydre liquide, pâteux ou solide; de dispersions aqueuses, huileuses ou en milieu solvant de type lotion ou sérum; de microémulsions; de microcapsules; de microparticules ou de dispersions vésiculaires de type ionique ou non ionique; sous forme fluide, épaissie ou gélifiée, semi-solide, pâte souple;  
15 sous forme solide telle que de stick ou bâton.

Cette composition peut être plus ou moins fluide et avoir l'aspect d'une crème blanche ou colorée, d'une pommade, d'un lait, d'une lotion, d'un sérum; d'une  
20 pâte, d'une mousse. Elle peut éventuellement être appliquée sur la peau sous forme d'aérosol. Elle peut également se présenter sous forme solide, et par exemple sous forme de stick. Elle peut être utilisée comme produit de soin et/ou comme produit de maquillage de la peau.

Lorsque la composition de l'invention est une émulsion, la proportion de la phase  
25 grasse peut aller de 5 à 80 % en poids, et de préférence de 5 à 50 % en poids par rapport au poids total de la composition. Les matières grasses, les émulsionnants et les coémulsionnants utilisés dans la composition sous forme d'émulsion sont choisis parmi ceux classiquement utilisés dans le domaine considéré. L'émulsionnant et le coémulsionnant sont de préférence présents, dans la composition,  
30 une proportion allant de 0,3 à 30 % en poids, et de préférence de 0,5 à 20 % en poids par rapport au poids total de la composition.

En outre, on peut aussi associer aux agents tenseurs utilisés selon l'invention d'autres composés connus par l'homme du métier comme agents tenseurs ayant  
35 des propriétés différentes de celles des agents utilisés selon l'invention, notamment une protéine ou hydrolysate de protéine. Comme composés de ce type, on peut citer par exemple les protéines de lait comme le lactalbumine, les protéines végétales telles que la protéine de soja vendue sous le nom d'Eleseryl par la société LSN ou le dérivé d'avoine vendu sous la dénomination « Reductine » par la  
40 société Silab, les acides nucléiques comme l'ADN.

Les compositions selon l'invention trouvent une application notamment comme compositions cosmétiques ou pharmaceutiques pour la peau, les muqueuses et/ou les semi-muqueuses.

Elles trouvent une application toute particulière en tant que produit de protection ou de soin de la peau du visage, du cou, des mains ou du corps, notamment en tant que composition anti-rides, anti-fatigue permettant de donner un coup d'éclat à la peau. On peut également envisager une application dans le domaine des compositions de maquillage de la peau du visage ou du corps, telles que les rouges à lèvres, les fonds de teint, les crèmes teintées, les sticks anti-cernes; ou les compositions anti-solaires ou de bronzage artificiel.

La composition de l'invention constitue plus particulièrement une composition anti-rides pour la peau du visage et/ou du cou.

L'invention est illustrée plus en détail dans les exemples suivants.

### **Exemple 1**

Préparation du composé de formule (I) dans laquelle :

$R_1 = \text{CH}_3$ ,  $X = \text{O}$ ,  $R_2 = -\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{pOH}$ ,  $R_3 = \text{H}$  et  $n = 100$  (indice théorique)

Dans un ballon de 500 ml, sous agitation, on introduit 20 g (0,096 mole) de N-carboxyanhydride tyrosine, 0,51 g (0,003 mole) de méthylate de sodium dans le méthanol, et 200 ml de tétrahydrofurane anhydre.

On mélange vivement pendant 6 heures à 60°C. Un dégagement important de  $\text{CO}_2$  se produit. A la fin de la réaction, on ajoute 10 ml d'eau. On évapore les solvants sous pression réduite.

On obtient 15 g de poudre de couleur jaune, soit un rendement de 96%.

### **Exemple 2**

Préparation du composé formule (I) dans laquelle :

$R_1 = \text{H}$ ,  $X = \text{O}$ ,  $R_2 = \text{H}$ ,  $R_3 = \text{CH}_3$ ,  $R'_2 = -\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_4-\text{pOH}$  et  $R'_3 = \text{H}$ .

Dans un ballon de 25 ml, on introduit 1,34 g (6,5 mmole) de N-carboxyanhydride tyrosine, 0,083 g (0,72 mmole) de N-carboxyanhydride sarcosine, 10 ml de dioxane anhydre et 0,043 ml d'une solution de triéthanolamine à 0,03% dans le dioxane, sous agitation. On chauffe à 37°C pendant 24 heures. Un dégagement important de  $\text{CO}_2$  se produit. On évapore le solvant sous pression réduite.

On obtient 1,3 g de poudre de couleur jaune.

Le rapport théorique de motifs sarcosine par rapport aux motifs tyrosine est de 9.

**Exemple 3**

Préparation du composé formule (I) dans laquelle :

5  $R_1 = -(\text{CH}_2)_4\text{-CH}(\text{NH}_2)\text{-COOH}$ ,  $X = \text{NH}$ ,  $R_2 = \text{H}$ ,  $R_3 = \text{CH}_3$ ,  $R'_2 = -\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_4\text{-pOH}$  et  $R'_3 = \text{H}$ .

10 Dans un ballon de 100 ml muni d'un réfrigérant et d'un bulleur, on introduit 4,5 g (22,7 mmole) de N-carboxyanhydride tyrosine, 0,5 g (4,5 mmole) de N-carboxyanhydride sarcosine, 50 ml de tétrahydrofurane anhydre et 1,5 ml (0,21 mmol) d'une solution de L-lysine à 1% dans le dioxane, sous vive agitation.

On chauffe au reflux du THF pendant 6 heures. Un dégagement important de  $\text{CO}_2$  se produit. Après retour à  $20^\circ\text{C}$ , on précipite le tout avec 50 ml d'acétate d'éthyle sous agitation, puis on filtre sur fritté n°3 et on sèche sous vide à  $40^\circ\text{C}$ .

On obtient 3,7 g de poudre de couleur blanche.

15 Le rapport théorique de motifs tyrosine par rapport aux motifs sarcosine est de 5.

**Exemple 4 : Crème antirides**

On prépare une émulsion eau-dans-huile comprenant (% en poids):

20

Phase A

- Polyisobutène hydrogéné	5,5%
- Neopentanoate d'isostéaryle	3,5%
- Stéarate de PEG-20	1%
25 - Stéarate de glycérol + stéarate de PEG-100	2%
- Alcool cétylique	0,5%
- Alcool stéarylique	0,5%
- Acide stéarique	1%

30

Phase B

- Cyclométhicone	11%
------------------	-----

Phase C

- polyacrylamide + isoparaffine C13-14 + laureth-7	1%
--	----

35

Phase D

- composé de l'exemple 1	7%
- eau	25%

40

Phase E

- conservateurs	qs
- triéthanolamine	0,03%
- Eau déminéralisée	qsp 100%

- On chauffe la phase A sous agitation jusqu'à homogénéité. Après refroidissement, on ajoute la phase B. On chauffe la phase E sous agitation, puis on verse E dans A toujours sous agitation. Après refroidissement à 50°C, on incorpore la phase C à l'émulsion, puis la phase D.
- On obtient une émulsion eau-dans-huile susceptible d'être employée comme crème anti-rides

### **Exemple 5 : Sérum anti-vieillessement**

10

On prépare un sérum en mélangeant (% en poids) :

- |  |          |
|--|----------|
| - polyacrylamide + isoparaffine C13-14 + laureth-7 | 1%       |
| - gomme xanthane                                   | 0,2%     |
| - PVM/MA décadiène crosspolymer                    | 0,2%     |
| - triéthanolamine                                  | 0,2%     |
| - composé de l'exemple 1                           | 3,5%     |
| - conservateurs                                    | qs       |
| - eau  | qsp 100% |

### **Exemple 6 : Evaluation de l'effet tenseur par mesure au Dermomètre**

- On évalue l'effet 'tenseur' des composés selon l'invention par mesure au dermomètre. Cet appareil a été décrit par L. Rasseneur et al. dans Influence des Différents Constituants de la Couche Cornée sur la Mesure de son Elasticité, International Journal of Cosmetic Science, 4, 247-260 (1982). Le principe consiste à mesurer avant traitement et après traitement la longueur d'une éprouvette de stratum cornéum isolé et de déterminer le pourcentage de rétraction de l'éprouvette.

- On utilise des éprouvettes de 0,6 cm x 0,4 cm de stratum cornéum d'épaisseur allant de 10 à 20  $\mu$ m disposées sur l'extensiomètre MTT 610 commercialisé par la société DIASTRON.

- L'éprouvette est placée entre-2 mâchoires puis laissée pendant 12 heures dans une atmosphère à 30°C et 40% d'humidité relative. Ces mâchoires sont alors fixées sur le Dermomètre.

- On tracte à la vitesse de 1 mm/minute l'éprouvette d'une longueur comprise entre 5 et 10 % de la longueur initiale pour déterminer la longueur  $L_0$  à partir de laquelle l'éprouvette commence à exercer une force sur les mâchoires et détectée par l'appareil.

- On détend ensuite l'éprouvette puis on applique sur le stratum cornéum 2 mg de la composition à tester.

- Pour préparer ces compositions, les composés sont solubilisés à chaud (60°C) dans le DMF, à une concentration de 7% en poids; la solution est maintenue à 60°C jusqu'à solubilisation complète. Elle est refroidie à 30°C avant utilisation.



On applique donc sur l'éprouvette la composition. Après évaporation totale de la composition (30 minutes de séchage), on tracte l'éprouvette dans les mêmes conditions que celles décrites précédemment pour déterminer également la longueur  $L_1$  pour l'éprouvette traitée.

Le pourcentage de rétraction est déterminé par le rapport :  $100 \times (L_1 - L_0) / L_0$   
 Pour caractériser un effet tenseur, ce pourcentage doit être négatif et l'effet tenseur est d'autant plus important que la valeur absolue du pourcentage de rétraction est élevée.

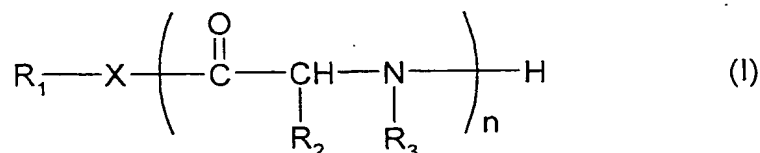
On obtient les résultats suivants (moyenne et écart-type sur 7 échantillons) :

Variation de la longueur de l'échantillon de stratum corneum en % et cinétique de l'effet :

Composé	1H	2H	3H	Std-1H	Std-2H	Std-3H
Exemple 1	-0,9	-1,6	-1,5	1,4	1,1	1,1
Exemple 2	-1,3	-1,1	-0,9	0,7	0,7	0,5
Exemple 3	-1,5	-1,1	-0,5	1,4	1,0	1,1

## REVENDICATIONS

- 5 1. Composition antirides comprenant, dans un milieu physiologiquement acceptable, au moins un composé de formule (I) :



dans laquelle :

10

- X est choisi parmi -O-, -S- ou -NR, avec R représentant un atome d'hydrogène ou un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

- R<sub>1</sub> est choisi parmi :

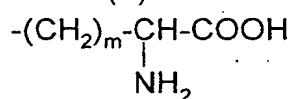
15

(i) un atome d'hydrogène,

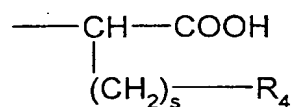
(ii) un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>40</sub>, éventuellement substitué par au moins un hydroxy ou un radical -NR'R'', dans lequel R' et R'' représentent, indépendamment l'un de l'autre, un atome d'hydrogène ou un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; et/ou éventuellement interrompu par au moins un hétéroatome choisi parmi N, O ou Si,

20

(iii) un radical choisi parmi



et



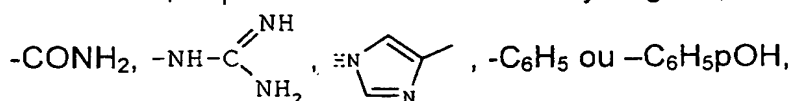
dans lesquels :

25

- m est 1, 2, 3, 4 ou 5;

- s est un entier compris entre 0 et 4 inclus;

- R<sub>4</sub> représente un atome d'hydrogène, -NH<sub>2</sub>, -OH, -SH, -CHOHCH<sub>3</sub>,



30

- R<sub>2</sub> représente un atome d'hydrogène, un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, ou un radical choisi parmi -CH<sub>2</sub>OH, -CHOH-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, -CH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>p-OH et -(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-NH<sub>2</sub>, avec t étant 1, 2, 3, 4 ou 5;

35

- R<sub>3</sub> représente un atome d'hydrogène ou un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

- n est un nombre moyen d'unités répétitives supérieur à 1, et tel que le poids moléculaire du dérivé de polyaminoacide est compris entre 200 et 200.000, l'unité répétitive étant soit identique pour un même composé, soit différente, R<sub>2</sub> et/ou R<sub>3</sub> prenant alors au moins l'une des autres significations données pour ces radicaux, ou un de ses sels minéraux ou organiques.

5.

2. Composition selon la revendication 1, dans laquelle X représente O, S ou N-CH<sub>3</sub>.

10 3. Composition selon l'une des revendications précédentes, dans laquelle R<sub>1</sub> représente un atome d'hydrogène; un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>22</sub>, notamment en C<sub>4</sub>-C<sub>20</sub>, ou un radical choisi parmi :



15

dans lesquels m, s et R<sub>4</sub> ont les significations données ci-dessus.

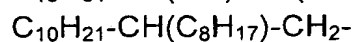
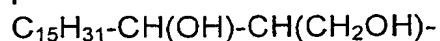
4. Composition selon l'une des revendications précédentes, dans laquelle R<sub>2</sub> représente un atome d'hydrogène, un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, ou un radical -CH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>p-OH.

20

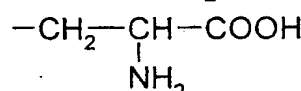
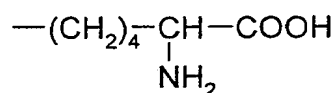
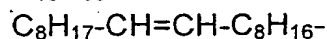
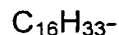
5. Composition selon l'une des revendications précédentes, dans laquelle R<sub>3</sub> représente un atome d'hydrogène ou un radical hydrocarboné, linéaire ou ramifié, saturé ou insaturé, en C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, notamment méthyle ou éthyle.

25

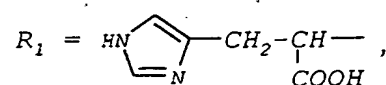
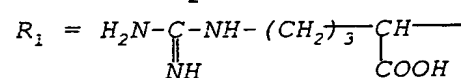
6. Composition selon l'une des revendications précédentes, dans laquelle R<sub>1</sub> représente l'une des formules suivantes :

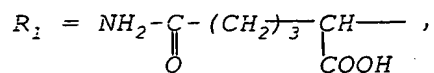


30



35





- 5 7. Composition selon l'une des revendications précédentes, dans laquelle n est compris entre 3 et 500 et/ou est tel que le poids moléculaire du dérivé de poly-aminoacide est compris entre 300 et 50 000.
- 10 8. Composition selon l'une des revendications précédentes, dans laquelle les composés de formule (I) sont présents, seuls ou en mélange, en une quantité de 0,001 à 30% en poids par rapport au poids total de la composition, de préférence en une quantité de 0,01 à 15% en poids par rapport au poids total de la composition.
- 15 9. Composition selon l'une des revendications précédentes, se présentant sous la forme d'une composition cosmétique ou pharmaceutique comprenant un milieu cosmétiquement ou pharmaceutiquement acceptable.
- 20 10. Composition selon l'une des revendications précédentes, comprenant en outre des agents tenseurs tels qu'une protéine ou hydrolysate de protéine, et notamment les protéines de lait comme le lactalbumine, les protéines végétales telles que la protéine de soja et le dérivé d'avoine ; les acides nucléiques comme l'ADN.
- 25 11. Composition selon l'une des revendications précédentes, se présentant sous forme d'une solution aqueuse, hydroalcoolique ou huileuse; d'une émulsion huile-dans-eau, eau-dans-huile ou multiple, de consistance liquide ou semi-liquide du type lait, ou de consistance molle, semi-solide ou solide du type crème; d'un gel aqueux ou huileux; d'un produit anhydre liquide, pâteux ou solide; de dispersions aqueuses, huileuses ou en milieu solvant de type lotion ou sérum; de microémulsions; de microcapsules; de microparticules ou de dispersions vésiculaires de
  - 30 type ionique ou non ionique; sous forme fluide, épaissie ou gélifiée, semi-solide, pâte souple; sous forme solide telle que de stick ou bâton ; d'une crème blanche ou colorée, d'une pommade, d'un lait, d'une lotion, d'un sérum, d'une pâte, d'une mousse ; d'aérosol ; sous forme solide, et par exemple sous forme de stick.
  - 35
- 40 12. Composition selon l'une des revendications précédentes, se présentant sous la forme d'un produit de protection ou de soin de la peau du visage, du cou, des mains ou du corps, notamment en tant que composition anti-rides, anti-fatigue permettant de donner un coup d'éclat à la peau ; ou sous la forme d'une composition de maquillage de la peau du visage ou du corps, telle qu'un rouge à lèvres, un fond de teint, une crème teintée, un stick anti-cernes; une composition anti-solaires ou de bronzage artificiel.

13. Composition selon l'une des revendications précédentes, se présentant sous la forme d'une composition antirides pour la peau du visage et/ou du cou.


5 14. Utilisation d'au moins un composé de formule (I) tel que défini dans l'une des revendications 1 à 7, ou d'une composition cosmétique le comprenant, pour diminuer, effacer et/ou lisser les rides et/ou les ridules de la peau.

10 15. Utilisation d'au moins un composé de formule (I) tel que défini dans l'une des revendications 1 à 7, pour la fabrication d'une composition pharmaceutique destinée à diminuer, effacer et/ou lisser les rides et/ou les ridules de la peau.

15 16. Utilisation d'au moins un composé de formule (I) tel que défini dans l'une des revendications 1 à 7, ou d'une composition le comprenant, comme agent tenseur pour diminuer, lisser et/ou effacer les rides et/ou les ridules de la peau.

20 17. Procédé de traitement cosmétique d'une peau ridée consistant à appliquer sur la ride et/ou la ridule, une composition comprenant au moins un composé de formule (I) tel que défini dans l'une des revendications 1 à 7.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

<b>Vos références pour ce dossier</b> (facultatif)		OA01091/CD	
<b>N° D'ENREGISTREMENT NATIONAL</b>		0102979	
<b>TITRE DE L'INVENTION (200 caractères ou espaces maximum)</b>			
Composition antirides comprenant un dérivé de polyamioacides, et utilisation de ce composé pour lutter contre les rides de la peau			
<b>LE(S) DEMANDEUR(S) :</b>			
L'OREAL 14 rue Royale 75008 PARIS FRANCE			
<b>DESIGNE(NT) EN TANT QU'INVENTEUR(S) : (Indiquez en haut à droite «Page N° 1/1» S'il y a plus de trois inventeurs, utilisez un formulaire identique et numérotez chaque page en indiquant le nombre total de pages).</b>			
<b>Nom</b>		PHILIPPE	
<b>Prénoms</b>		Michel	
<b>Adresse</b>	<b>Rue</b>	34 rue Pierre et Marie Curie	
	<b>Code postal et ville</b>	91320	WISSOUS
<b>Société d'appartenance (facultatif)</b>			
<b>Nom</b>		BENARD	
<b>Prénoms</b>		Sylvie	
<b>Adresse</b>	<b>Rue</b>	4 Allée du Parc	
	<b>Code postal et ville</b>	95570	ATTAINVILLE
<b>Société d'appartenance (facultatif)</b>			
<b>Nom</b>			
<b>Prénoms</b>			
<b>Adresse</b>	<b>Rue</b>		
	<b>Code postal et ville</b>		
<b>Société d'appartenance (facultatif)</b>			
<b>DATE ET SIGNATURE(S) DU (DES) DEMANDEUR(S) OU DU MANDATAIRE (Nom et qualité du signataire) Le 3/05/01</b>			
Françoise LE BLAINVAUX			

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**FINNEGAN, HENDERSON, FARABOW,  
GARRETT & DUNNER, L.L.P.  
1300 I STREET, N.W.  
WASHINGTON, D.C. 20005**

**NEW U.S. PATENT APPLICATION  
FILING DATE: MARCH 4, 2002  
INVENTORS: MICHEL PHILIPPE ET AL.  
ATTY. DOCKET NO.: 05725.1033-00000**